

性 状：無色プリズム状晶

実施例 1

メチル N α -メチルトリプトファンネート

1. 0 g を、乾燥ジクロロメタン 30 ml に加え、0℃、アルゴン気流中、攪拌しながら、これに乾燥トリエチルアミン 1.63 ml を加えた。次に 3, 4, 5-トリメトキシベンゾイルクロライド 901 mg を徐々に加えた後、室温にて 40 分間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出し、食塩水、1 N 塩酸、食塩水、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液；クロロホルム：メタノール＝200：1）にて精製して、メチル N α -メチル-N α -(3, 4, 5-トリメトキシベンゾイル)トリプトファンネート 1.459 g を得た。

IR (CDCl₃, ν : cm⁻¹)3 4 7 5、1 7 3 8、1 6 2 7、1 5 8 5、
1 4 1 1、1 2 3 8、1 2 1 5、1 1 2 8NMR (CDCl₃) δ :

7.32 (d, J = 8.4 Hz),
7.65 (broad), 8.42 (broad)
8.44 (broad), 2.82 (broad s)
3.10 (broad s)
3.50 (3H, broad s)
3.63 (3H, broad s)
3.78 (3H, s), 3.84 (3H, s)
3.1-3.7 (2H, m)
4.90 (m), 5.56 (m)
6.07 (broad), 6.22 (broad)
6.93 (m), 7.15 (m)

MS (マススペクトル, 70 eV): m/z

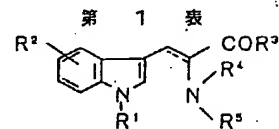
426 (M⁺), 226, 225, 202,
201, 196, 195, 170, 152,
131, 130

- 95 -

実施例 2～58

適当な出発原料を用いて、実施例 1 と同様にし、下記第 1 表に示す各化合物を得た。

また得られた各化合物の性状（融点、NMR、IR、MS）及び結晶形（再結晶溶媒）を第 2 表に示す。





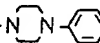






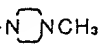



| 実施例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | 側鎖の結合 |
|-----|----------------|----------------|------------------|-----------------|---|-------|
| 2 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-C ₆ H ₄ -Br | 1 |
| 3 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅ | 1 |
| 4 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-C ₆ H ₃ (NO ₂) ₂ | 1 |
| 5 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-C ₆ H ₃ (NO ₂) ₂ | 1 |
| 6 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-C ₆ H ₃ (NO ₂) ₂ | 1 |
| 7 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-C ₆ H ₄ -CN | 1 |
| 8 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-C ₆ H ₄ -I | 1 |


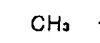


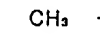


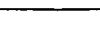
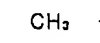
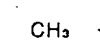
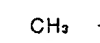
- 97 -

-259-



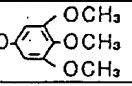





- 98 -

| 実施例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | 側鎖の結合 |
|-----|----------------|----------------|--|-----------------|---|-------|
| 9 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -COCH=CH-  | 1 |
| 10 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  | 1 |
| 11 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 12 | H | H | OH | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 13 | H | H | -N  -  | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 14 | H | H | -N  O | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 15 | H | H | -NH  | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 16 | H | H | -N  NCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |

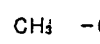
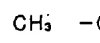
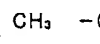
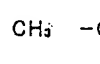
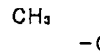

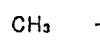

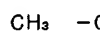

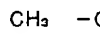
- 99 -

| 実施例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | 側鎖の結合 |
|-----|---|----------------|---|-----------------|---|-------|
| 17 | H | H | -N  | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 18 | H | H | H-N  | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 19 | CH ₃ | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 20 | -CH ₂ CH CH ₂ | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 21 |  | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 1 |
| 22 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  OCH ₃ | 1 |
| 23 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  OCH ₃ OCH ₃ | 1 |
| 24 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -F | 1 |

- 100 -

| 実施例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | 側鎖の結合 |
|-----|----------------|----------------|------------------|-----------------|---|-------|
| 25 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -NO ₂ | 1 |
| 26 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -SO ₂ -  -CH ₃ | 1 |
| 27 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  | 2 |
| 28 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -Br | 2 |
| 29 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  | 2 |
| 30 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  | 2 |
| 31 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  | 2 |
| 32 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  | 2 |

- 101 -

| 実施例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | 側鎖の結合 |
|-----|----------------|----------------|--|-----------------|--|-------|
| 33 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -CN | 2 |
| 34 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  -I | 2 |
| 35 | H | H | OH | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 2 |
| 36 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -COC=C-  | 2 |
| 37 | H | H | OCH ₃ | CH ₃ | -CO-  | 2 |
| 38 | H | H | -NH  | CH ₃ | -CO-  | 2 |
| 39 | H | H | -N  O | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 2 |
| 40 | H | H | -NH  | CH ₃ | -CO-  -Cℓ | 2 |

- 102 -